

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公 開 特 許 公 報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平10-120542

(43) 公開日 平成10年(1998) 5月12日

(51) Int.Cl.<sup>6</sup>

A 6 1 K 7/42

識別記号

F I

A 6 1 K 7/42

審査請求 未請求 請求項の数 1 F D (全 11 頁)

(21) 出願番号 特願平9-271934

(22) 出願日 平成9年(1997) 9月19日

(31) 優先権主張番号 1 9 6 3 8 5 3 4 . 2

(32) 優先日 1996年9月20日

(33) 優先権主張国 ドイツ (D E)

(71) 出願人 591010376

バイヤースドルフ・アクチエンゲゼルシャ  
フト

BEIERSDORF AKTIENGE  
SELLSCHAFT

ドイツ連邦共和国デー-20245ハンブル  
ク・ウンナシユトラーセ48

(71) 出願人 000119472

一丸ファルコス株式会社

岐阜県本巣郡真正町浅木318番地の1

(74) 代理人 弁理士 小田島 平吉

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 皮膚の褐色化のための、又は皮膚の日焼け、特にUV光線によりもたらされる皮膚の日焼けの予

(57) 【要約】 防のための、フェルラ酸トコフェリルの使用

【課題】 皮膚の褐色化のための、又は皮膚の日焼け予  
防のための化粧品または皮膚科学的調製物の提供。

【解決手段】 フェルラ酸トコフェリルを有効成分とし  
て含有する皮膚の望ましくない色素沈着の防止用調製  
物。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 皮膚の望ましくない色素沈着に対する、フェルラ酸トコフェリルの使用。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、化粧品による及び局所的皮膚科学的な皮膚の褪色化のため、あるいは皮膚の日焼け、特にUV光線によりもたらされる皮膚の日焼けの予防のための、それら自体知られた活性成分の使用に関する。

【0002】好ましい態様において、本発明は、例えば望ましくない色素沈着、例えば局所的色素沈着亢進及び色素沈着異常（例えばほくろ、そばかす）のような皮膚における、美容的又は皮膚科学的変化の予防及び治療のための、あるいは個人の皮膚のタイプに完全に適合する、より広い面積の、色素沈着皮膚の、純粋に化粧品としての褪色化のための、化粧品及び皮膚科学的調製物に関する。

【0003】

【従来の技術】メラニン細胞は、皮膚の色素沈着の原因となり、そして、皮膚のタイプにより、別個に又は種々の大きさの一団となって存在する色素形成細胞として、基底細胞に沿った、一番下の表皮層の基底層（Stratum basale）中に認めることができる。メラニン細胞は、特徴的な細胞小器官として、UV光線に刺激されると、大量にメラニンを形成するメラノソームを含有している。これがケラチノサイト中に運搬されて、多かれ少なかれ、褐色がかった色から褐色の皮膚の色をもたらす。

【0004】メラニンは酸化過程の最終段階として形成され、そこではチロシンは、酵素のチロシン分解酵素の作用下で、3, 4-ジヒドロキシフェニルアラニン（ドーパ）、ドーパキノン、ロイコドーパクロム、ドーパクロム、5, 6-ジヒドロキシインドール及びインドール-5, 6-キノンを経由して最終的にメラニンに転化される。

【0005】皮膚の色素沈着亢進症に伴う問題は、多くの異なった原因を有し、そして多くの生物学的過程の付随的現象、例えばUV光線【例えばそばかす、（*Ephelides*）】、遺伝的傾向、皮膚の治癒もしくは癒痕化及び皮膚の老化【例えば老人性ほくろ（*Lentigines senile s*）】の期間の、皮膚の色素沈着異常である。

【0006】皮膚の色素沈着に拮抗する活性成分及び調

製物は知られている。一方で、これらは数週間の投与後に初めてそれらの効果を示し、そして他方では、それらの過剰に長期間の投与は、毒物学的な理由により危険ではあるが、実質的な使用は本質的に、ヒドロキノンを基礎にした調製物からなる。それは化粧品としての及び皮膚科学的な欠点を有するが、コージ酸、アスコルビン酸及びアゼライン酸及びそれらの誘導体のような物質によるチロシン分解酵素の抑制はまた一般的である。

【0007】

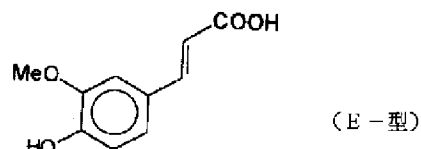
【発明が解決しようとする課題】本発明の目的は、これらの問題を解決することであった。

【0008】

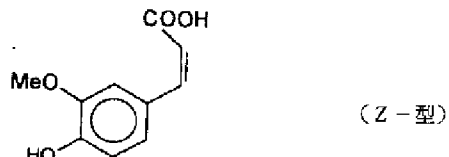
【発明の構成】フェルラ酸（4-ヒドロキシ-3-メトキシケイ皮酸、カフェイン酸3-メチルエーテル）は抗酸化性を有することが知られている。それは、構造式

【0009】

【化1】



又は

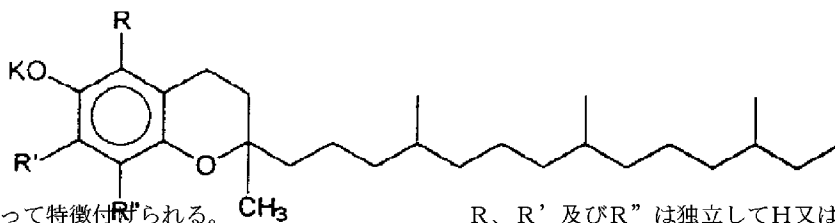


【0010】の特徴を有する。それは植物中に非常に一般的であり、そして例えば、その名称が由来する、セリ科の植物のアギ（*Ferula asafoetida*）及びフェルラ・ナルテックス（*Ferula nartex*）の塊茎、穀類及びゴム樹脂中に存在する。E型は通常の下で無色の結晶状固体であり、そしてZ型は通常の下で黄色がかった油である。

【0011】ビタミンE活性を有するトコフェロール及びそれらのエステルは基礎物質、トコール〔2-メチル-2-（4, 8, 12-トリメチルトリデシル）クロマン-6-オール〕から誘導されそして下記の構造：

【0012】

【化2】



【0013】によって特徴付けられる。

【0014】KはH又はアシル基のどちらかであり、

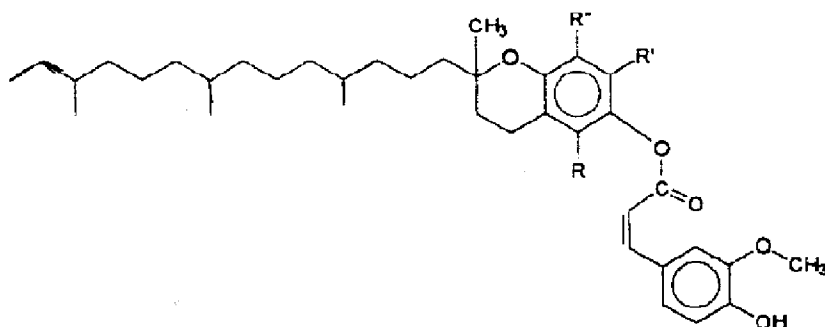
R、R' 及びR'' は独立してH又はメチル基である、例えば：

$R=R'=R''=K=H$   
 $R=R'=R''=\text{メチル}, K=H$   
 $R=R''=\text{メチル}, R'=K=H$   
 $R'=R''=\text{メチル}, R=K=H$   
 $R''=\text{メチル}, R=R'=K=H$   
 $R=\text{メチル}, R'=R''=K=H$   
 $R=R'=\text{メチル}, R''=K=H$   
 $R'=\text{メチル}, R=R''=K=H$

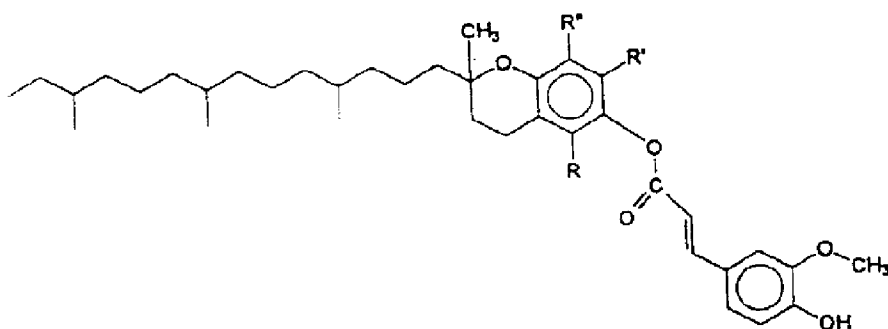
: トコール  
 :  $\alpha$ -トコフェロール  
 :  $\beta$ -トコフェロール  
 :  $\gamma$ -トコフェロール  
 :  $\delta$ -トコフェロール  
 :  $\epsilon$ -トコフェロール  
 :  $\zeta$ -トコフェロール  
 :  $\eta$ -トコフェロール。

**【0015】** 自然界に最も頻繁に存在しそして最も重要な、 $\alpha$ -トコフェロールは、2R, 4'R, 8'Rの配置を有する。それは時々RRR- $\alpha$ -トコフェロールとも称される。  
**【0016】** フェルラ酸トコフェリルは、フェルラ酸の

異性体型又は種々のトコフェロール基礎物質に応じて、  
 構造式  
**【0017】**  
**【化3】**



又は



**【0018】** [式中、R、R'及びR''は前記に定義されたものである] によって特定される。

**【0019】** フェルラ酸トコフェリルの製造法及びその性状は、日本のイチマル製薬会社 (Ichimaru Pharcos K K) に属する、特開昭60-222476号公報及び、関連する特開昭86-052151号公報に記載されている。特に、フェルラ酸トコフェリルの化粧品としての使用及び、抗酸化剤としてのその性状に対して前記の引用文献を参照している。

**【0020】** 反対に、皮膚の望ましくない色素沈着に対するフェルラ酸トコフェリルの使用あるいは、皮膚の望ましくない色素沈着に対する、有効量のフェルラ酸トコフェリルを含有する化粧品又は皮膚科学的調製物の使用が、従来の当該技術の不都合を是正することは驚くべきことであり、当業者にとり予知できなかった。

**【0021】** その結果、フェルラ酸トコフェリルは、そ

れが単一物質、又は異性体の混合物、又は異なったフェルラ酸トコフェリルの混合物、のいずれの形態であろうが、集合的に「本発明に従って使用される活性成分」とも称されるが、望ましくない色素沈着、特に局所的色素沈着亢進に対して、そして、UV光線によりもたらされる日焼けに対して、予防及び治療の両者の意味において、優れた活性成分であることが判明した。

**【0022】** 本発明の目的に対して好ましいフェルラ酸 $\alpha$ -トコフェリル [同義語：フェルラ酸ビタミンE、化学名 (4''-ヒドロキシ-3''-メトキシケイ皮酸) 2, 5, 7, 8-テトラメチル-2-(4', 8', 12'-トリメチルトリデシル)-6-クロマンル] は、ケミカル・アブストラクツ (Chemical Abstracts) に登録番号21290-29-9として、以前は17175-56-3として登録されている。

**【0023】** フェルラ酸DL- $\alpha$ -トコフェリルは特に

好ましい。フェルラ酸基のE及びZ配置の異性体は同等に有効である。

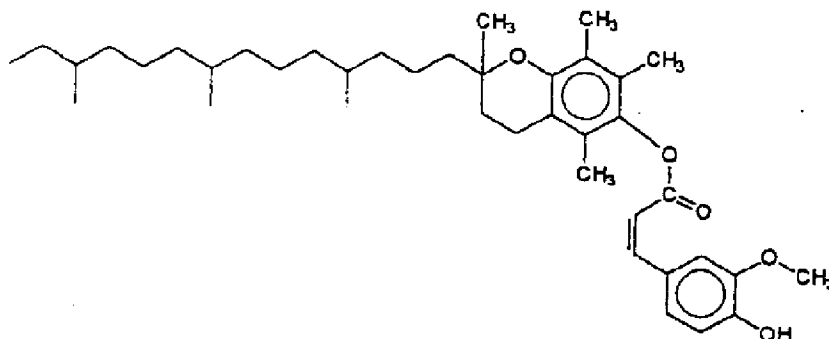
【0024】特開昭60-222476号公報及び関連の特開昭86-052151号公報は、本発明の目的に好都合に使用できる、すべての考え得るフェルラ酸トコフェリルのための特定の合成方法については記載しているわけではないが、当業者は、これらの明細書中の情報を使用して、そして更に、一般的な専門家の知識により、例えば、明細書に公表された出発トコフェロール

を、明細書に公表されてはいないであろう出発トコフェロールにより置換することにより、そしてその他は類似の方法を実施することにより、所望の個々の生成物をいかにして得るか知っている。

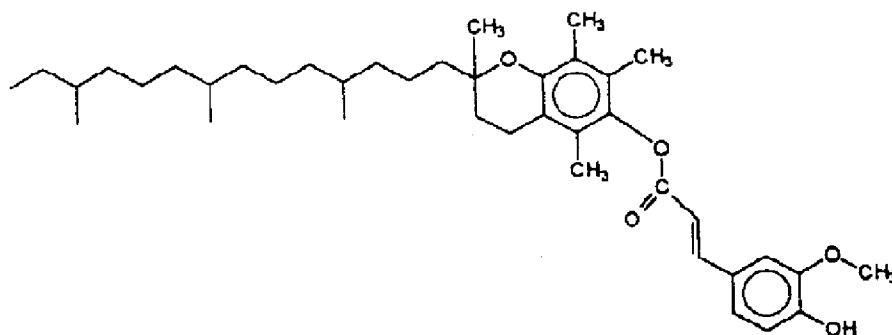
【0025】フェルラ酸基の配置に応じて、本発明により好ましい物質は、トコフェリル基上の不斉中心の配置を考慮しないと、構造

【0026】

【化4】



又は



【0027】を有する。

【0028】本発明によると、化粧品又は局所用皮膚科学的調製物中に本発明に従って使用される活性成分の含量は、調製物の総重量の0.01～10重量%、好ましくは0.1から5重量%、特に0.2～2.0重量%にすることができる。

【0029】驚くべきことに、本発明に従い使用される活性成分が、本発明が主眼とする目的を達成することが判明した。本発明に従い使用される活性成分、あるいは本発明に従い使用される活性成分の活性量を含有する化粧品又は局所用皮膚科学的調製物を使用することにより、望ましくない色素沈着に対する有効な予防を達成する、例えばUV光線の影響による望ましくない色素沈着を予防する、ことができる。しかしまた、本発明に従って使用される活性成分、あるいは本発明に従って使用される活性成分の活性量を含有する化粧品又は局所用皮膚科学的調製物を、望ましくない皮膚の色素沈着、例えば老人性ほくろ、の化粧品による又は皮膚科学的処置のために使用することも本発明に従い著しく好適である。

【0030】本発明に従って使用される活性成分、あるいは本発明に従って使用される活性成分の活性量を含有する化粧品による又は局所用皮膚科学的調製物による予防、あるいは化粧品による又は皮膚科学的処置は、本発明に従って使用される活性成分、あるいは本発明に従って使用される活性成分の活性量を含有する化粧品又は局所用皮膚科学的調製物を、皮膚の疾患部位に投与することにより、通常の方法で実施される。

【0031】本発明に従って使用される活性成分は好都合には、種々の形態で存在することができる、通常の化粧品及び皮膚科学的調製物に取り込むことができる。それらは例えば、溶液、油中水(W/O)型もしくは水中油(O/W)型のエマルション、又は複エマルション、例えば水中油中水(W/O/W)型もしくは油中水中油(O/W/O)型のエマルション、ヒドロ分散物もしくは脂質分散物、ゲル、固体スティック又はエアゾールにすることができる。

【0032】例えばクリーム、ローション又は化粧品乳液の形態の、本発明の範疇における本発明によるエマル

ションは好都合であり、そして例えば、脂肪、油、ワックス及び／又はその他の脂肪物質、並びに水及び、この種の調製物のために伝統的に使用されるような１種類以上の乳化剤、を含有する。

【００３３】本発明の目的のために、皮膚及び毛髪的清浄化のための水性系又は界面活性調製物に、本発明に従って使用される活性成分を添加することもまた可能でありそして好都合である。

【００３４】当業者はもちろん、要求の厳しい化粧品組成物はたいいていの場合、通常の補助剤及び添加剤なしには考えられないことは知っている。これらは例えば、コンシステンシー調節剤、充填剤、香料、染料、乳化剤、ビタミンもしくは蛋白質のような追加的活性成分、光線及びその他の安定剤、忌虫剤、アルコール、水、塩、抗バクテリア、蛋白分解もしくは角質溶解物質、等を含む。

【００３５】医薬調製物の調製に関して対応する必要条件が、必要な変更を加えて適用される。

【００３６】本発明の範疇における医薬用局所組成物は概括的に、有効濃度の、１種類以上の医薬を含有する。簡略化のため、化粧品及び医薬的使用及び対応する製品の間を明確に区別するために、ドイツ連邦共和国の法令（例えば化粧品規定、食品及び医薬品条例）を参照している。

【００３７】その他の目的のためのその他の活性成分をすでに含有している調製物に、添加剤として、本発明に従って使用される活性成分を添加することもまた好都合である。

【００３８】従って、本発明の範疇の化粧品又は局所用皮膚科学的組成物は、それらの組成に応じて、例えば、皮膚の保護用クリーム、クレンジング用乳液、日焼け止めローション、栄養クリーム、日中用もしくは夜間用クリーム等として、使用することができる。望ましいなら、本発明による組成物を、製薬学的調製物の基剤として使用することが可能であり、好都合である。

【００３９】適当なら、日焼け止め剤の形態で存在する化粧品及び皮膚科学的調製物もまた好ましい。本発明に従って使用される活性成分に加えて、これらはまた、好ましくは、少なくとも１種類のＵＶＡフィルター物質及び／又は少なくとも１種類のＵＶＢフィルター物質及び／又は少なくとも１種類の無機顔料を含有する。

【００４０】しかし、その主要目的が日光に対する防御ではないが、それでも抗ＵＶ物質を含有するような化粧品及び皮膚科学的調製物を提供することもまた本発明の目的にとって好都合である。従って例えば、ＵＶ－Ａ及びＵＶ－Ｂフィルター物質は通常、日中用クリーム中に取り込まれる。

【００４１】本発明による調製物は好都合には、ＵＶＢ領域のＵＶ光線を吸収する物質を含有することができ、そのフィルター物質の総量は例えば、調製物の総重量の

０．１重量％から３０重量％、好ましくは０．５から１０重量％、特に１から６重量％である。

【００４２】ＵＶＢフィルターは油性でも水性でもよい。油性物質の例は：

- － ３－ベンジリデンカンファー及びその誘導体、例えば３－（４－メチルベンジリデン）カンファー；

- － ４－アミノ安息香酸誘導体、好ましくは４－（ジメチルアミノ）安息香酸２－エチルヘキシル、４－（ジメチルアミノ）安息香酸アミル；

- － ケイ皮酸のエステル、好ましくは４－メトキシケイ皮酸 ２－エチルヘキシル、４－メトキシケイ皮酸イソペンチル；

- － サリチル酸のエステル、好ましくはサリチル酸 ２－エチルヘキシル、サリチル酸 ４－イソプロピルベンジル、サリチル酸ホモメンチル；

- － ベンゾフェノンの誘導体、好ましくは２－ヒドロキシ－４－メトキシベンゾフェノン、２－ヒドロキシ－４－メトキシ－４’－メチルベンゾフェノン、２，２’－ジヒドロキシ－４－メトキシベンゾフェノン；

- － ベンザルマロン酸のエステル、好ましくは４－メトキシベンザルマロン酸ジ（２－エチルヘキシル）；

- － ２，４，６－トリアニリノー（ｐ－カルボ－２’－エチル－１’－ヘキシルオキシ）－１，３，５－トリアジンである。

【００４３】水溶性物質は好都合には：

- － ２－フェニルベンズイミダゾール－５－スルホン酸及びその塩、例えばナトリウム、カリウム又はトリエタノールアンモニウム塩、

- － ベンゾフェノンのスルホン酸誘導体、好ましくは２－ヒドロキシ－４－メトキシベンゾフェノン－５－スルホン酸及びその塩；

- － ３－ベンジリデンカンファーのスルホン酸誘導体、例えば、４－（２－オキソ－３－ボルニリデンメチル）ベンゼンスルホン酸、２－メチル－５－（２－オキソ－３－ボルニリデンメチル）スルホン酸及びその塩である。

【００４４】本発明に従って使用することができる前記のＵＶＢフィルターの表はもちろんそれらに限定することを意図されない。

【００４５】本発明はまた、本発明によるＵＶＡフィルターの、ＵＶＢフィルターとの、あるいは、これもまたＵＶＢフィルターを含有する本発明による化粧品又は皮膚科学的調製物、との組み合わせ物に関する。

【００４６】本発明による調製物中に、通常、化粧品及び／又は皮膚科学的調製物中に存在するＵＶＡフィルターを使用することもまた好都合である可能性がある。このようなフィルター物質は、好ましくはジベンゾイルメタンの誘導体、特に１－（４’－tert－ブチルフェニル）－３－（４’－メトキシフェニル）プロパン－１，３－ジオン及び１－フェニル－３－（４’－イソブ

ロピルフェニル) プロパン-1, 3-ジオンである。これらの組み合わせ物を含む調製物もまた本発明の主題物質である。UVBフィルター物質に対して与えられたものと同量のUVAフィルター物質を使用することができる。

【0047】本発明の範疇の化粧品及び／又は皮膚科学的調製物はまた、UV光線に対して皮膚を防御する、化粧品産業において通常使用される無機顔料を含むことができる。これらはチタン、亜鉛、鉄、ジルコニウム、ケイ素、マンガン、アルミニウム、セリウムの酸化物及びそれらの混合物、並びに、その中でそれらの酸化物が活性物質であるような誘導体である。二酸化チタンを基礎にした顔料が特に好ましい。前記の組み合わせ物に対して記載された量を使用することができる。本発明による化粧品及び皮膚科学的調製物は、このような調製物中に通常使用されるような化粧品活性成分、補助剤及び／又は添加剤、例えば抗酸化剤、保存剤、殺菌剤、香料、発泡抑制剤、染料、着色効果をもつ顔料、増粘剤、界面活性剤、乳化剤、可塑化剤、加湿物質及び／又は保湿物質、脂肪、油、ワックス又は、アルコール、ポリオール、ポリマー、気泡安定剤、電解質、有機溶媒又はシリコーン誘導体のような、化粧品又は皮膚科学的調製物のその他の通常の成分、を含むことができる。

【0048】本発明の範疇の調製物に、通常の抗酸化剤を添加することも同様に好都合である。本発明によると、前記の通常の抗酸化剤とは、化粧品及び／又は皮膚科学的用途に適宜か又は伝統的な、すべての抗酸化剤である可能性がある。

【0049】抗酸化剤は、非常に少量の許容投与量（例えば $\mu\text{mol}$ から $\text{mg}$ ）における、アミノ酸（例えばグリシン、ヒスチジン、チロシン、トリプトファン）及びそれらの誘導体、イミダゾール（例えばウロカニン酸）及びそれらの誘導体、D、L-カルノシン、D-カルノシン、L-カルノシン及びそれらの誘導体（例えばアンセリン）のようなペプチド、カロテノイド、カロテン（例えば $\alpha$ -カロテン、 $\beta$ -カロテン、リコペン）及びそれらの誘導体、リポ酸及びその誘導体（例えばジヒドロリポ酸）、アウロチオグルコース、プロピルチオウラシル、及びその他のチオール（例えばチオレドキシン、グルタチオン、システイン、シスチン、シスタミン並びに、それらのグリコシル、N-アセチル、メチル、エチル、プロピル、アミル、ブチル及びラウリル、パルミトイル、オレイル、 $\gamma$ -リノレイル、コレステリル及びグリセリルエステル）及びそれらの塩、チオジプロピオン酸ジラウリル、チオジプロピオン酸ジステアリル、チオジプロピオン酸及びその誘導体（エステル、エーテル、ペプチド、脂質、ヌクレオチド、ヌクレオシド及び塩）及びスルホキシイミン化合物（例えばブチオニンスルホキシイミン、ホモシステインスルホキ

シイミン、ブチオニンスルホン、ペンター、ヘキサ-、ヘプタチオニ-スルホキシイミン）、更にまた（金属）キレート化剤（例えば $\alpha$ -ヒドロキシ脂肪酸、パルミチン酸、フィチン酸、ラクtofフェリン）、 $\alpha$ -ヒドロキシ酸（例えばクエン酸、乳酸、リンゴ酸）、フミン酸、胆汁酸、胆汁抽出物、ビリルビン、ビリベルジン、EDTA、EGTA及びそれらの誘導体、不飽和脂肪酸及びそれらの誘導体（例えば $\gamma$ -リノレン酸、リノール酸、オレイン酸）、葉酸及びその誘導体、アラニン二酢酸、フラボノイド、ポリフェノール、カテコール、ユビキノ-ン及びユビキノール及びそれらの誘導体、ビタミンC及び誘導体（例えばパルミチン酸アスコルビル、リン酸アスコルビルMg、酢酸アスコルビル）、トコフェロール及び誘導体（例えば酢酸ビタミンE）、並びにベンゾインの安息香酸コニフェリル、ルチン酸（rutinic acid）及びその誘導体、フェルラ酸及びその誘導体、ブチル化ヒドロキシトルエン、ブチル化ヒドロキシアニソール、ノルジヒドログアヤク樹脂酸、ノルジヒドログアヤレチン酸、トリヒドロキシブチロフェノン、尿酸及びその誘導体、マンノース及びその誘導体、亜鉛及びその誘導体（例えば $\text{ZnO}$ 、 $\text{ZnSO}_4$ ）、セレン及びその誘導体（例えばセレン・メチオニン）、スチルベン及びそれらの誘導体（例えば酸化スチルベン及び酸化トランス-スチルベン）並びに、本発明により適切なこれらの活性成分の誘導体（塩、エステル、エーテル、糖、ヌクレオチド、ヌクレオシド、ペプチド及び脂質）である。調製物中の抗酸化剤（1種類以上の化合物）の量は好ましくは、調製物の総重量の0.001から30重量%、特に好ましくは、0.05~20重量%、特に1から10重量%である。

【0050】ビタミンE及び／又はその誘導体を抗酸化剤（類）として使用する場合には、それらのそれぞれの濃度を、調製物の総重量の0.001から10重量%の範囲内で選ぶことが好都合である。

【0051】本発明の範疇の化粧品又は皮膚科学的調製物が溶液又はエマルジョン又は分散物である場合は、使用される溶媒は：

- 水又は水溶液
- カプリン酸又はカプリル酸のトリグリセリドのような油、しかし好ましくはヒマシ油；
- 脂肪、ワックス並びにその他の天然の及び合成の脂肪物質、好ましくは低炭素数のアルコールと、例えばイソプロパノール、プロピレングリコール又はグリセロールと、脂肪酸のエステル、あるいは低炭素数のアルカン酸と又は脂肪酸と、脂肪アルコールのエステル；
- 低炭素数のアルコール、ジオール又はポリオール、並びにそれらのエーテル、好ましくはエタノール、イソプロパノール、プロピレングリコール、グリセロール、エチレングリコール、エチレングリコール・モノエチルもしくはモノブチル・エーテル、プロピレングリコール

・モノメチル、モノエチルもしくはモノブチル・エーテル、ジエチレングリコールモノメチルもしくはモノエチル・エーテル及び同様な製品にすることができる。

【0052】なかでも、前記の溶媒の混合物が使用される。アルコール性溶媒の場合には、水を更なる成分にすることができる。

【0053】本発明の範疇のエマルション、オレオゲル又はヒドロ分散物もしくは脂質分散物の油性相は好都合には、3から30個の炭素原子の鎖長をもつ、飽和及び／又は不飽和の、分枝及び／又は非分枝アルカンカルボン酸と、3から30個の炭素原子の鎖長をもつ、飽和及び／又は不飽和の、分枝及び／又は非分枝アルコールからなるエステルの群から、芳香族カルボン酸と、3から30個の炭素原子の鎖長をもつ飽和及び／又は不飽和の、分枝及び／又は非分枝アルコールからなるエステルの群から選ばれる。このようなエステルの油は次に、好都合には、ミリスチン酸イソプロピル、パルミチン酸イソプロピル、ステアリン酸イソプロピル、オレイン酸イソプロピル、ステアリン酸n-ブチル、ラウリン酸n-ヘキシル、オレイン酸n-デシル、ステアリン酸イソオクチル、ステアリン酸イソノニル、イソノナン酸イソノニル、パルミチン酸2-エチルヘキシル、ラウリン酸2-エチルヘキシル、ステアリン酸2-ヘキシルデシル、パルミチン酸2-オクチルドデシル、オレイン酸オレイル、エルカ酸オレイル、オレイン酸エルシル、エルカ酸エルシル並びに、合成、半合成及び天然の、このようなエステルの混合物、例えばジョジョバ油、からなる群から選ぶことができる。

【0054】更に、油性相は好都合には、分枝及び非分枝の炭化水素及びワックス、シリコーン油、ジアルキルエーテルからなる群、飽和もしくは不飽和の、分枝もしくは非分枝アルコールの群、並びに脂肪酸トリグリセリド、特に8から24個の、なかでも12から18個の炭素原子の鎖長をもつ、飽和及び／又は不飽和の、分枝及び／又は非分枝アルカンカルボン酸のトリグリセロールエステル、から選ぶことができる。該脂肪酸トリグリセリドは好都合には、例えば合成、半合成及び天然の油、例えば、オリーブ油、ヒマワリ油、大豆油、ピーナツ油、ナタネ油、アーモンド油、ヤシ油、ココナツ油、ヤシの芯油等からなる群から選ぶことができる。

【0055】このような油及びワックス成分のあらゆる所望の混合物もまた、本発明の目的に好都合に使用することができる。望ましい場合は、油性相の唯一の脂質成分として、ワックス、例えばパルミチン酸セチルを使用することも好適である可能性がある。

【0056】油性相は好都合には、イソステアリン酸2-エチルヘキシル、オクチルドデカノール、イソノナン酸イソトリデシル、イソエイコサン、ココア酸2-エチルヘキシル、安息香酸C<sub>12-15</sub>-アルキル、カプリル酸／カプリン酸トリグリセリド、ジカプリリルエーテルか

らなる群から選ばれる。

【0057】安息香酸C<sub>12-15</sub>-アルキルとイソステアリン酸2-エチルヘキシルの混合物、安息香酸C<sub>12-15</sub>-アルキルとイソノナン酸イソトリデシルの混合物、並びに安息香酸C<sub>12-15</sub>-アルキル、イソステアリン酸2-エチルヘキシル及びイソノナン酸イソトリデシルの混合物、が特に好都合である。

【0058】炭化水素のうちでは、パラフィン油、スクアラン及びスクアレンが、本発明の目的のために好都合である。

【0059】更に、油性相は好都合には、環状又は直線状シリコーン油を含有するかあるいは、前記シリコーン油もしくはシリコーン油類の他に、追加的な量のその他の油性相成分を使用することが好ましいが、独占的にこのような油からなることができる。

【0060】シクロメチコン（オクタメチルシクロテトラシロキサン）は好都合には、本発明に従って使用することができるシリコーン油として使用される。代替的には、その他のシリコーン油、例えばヘキサメチルシクロトリシロキサン、ポリジメチルシロキサン、ポリ（メチルフェニルシロキサン）が、本発明の目的のために好都合に使用することができる。

【0061】更に、シクロメチコンとイソノナン酸イソトリデシルの混合物並びにシクロメチコンとイソステアリン酸2-エチルヘキシルの混合物が特に好都合である。本発明に従い使用されるゲルは通常、油性-アルコール性ゲルに対しては、好ましくは二酸化ケイ素又はケイ酸アルミニウムであり、そして水性-アルコール性もしくはアルコール性ゲルに対しては、好ましくはポリアクリレートであるような増粘剤の存在下において、低炭素数のアルコール、例えばエタノール、イソプロパノール、1, 2-プロパンジオール、グリセロール及び水又は、前記のような油を含有する。

【0062】固形スティックは例えば、天然又は合成のワックス、脂肪アルコール又は脂肪酸エステルを含有する。口唇手入れ用スティック及び身体消臭用のスティック調製物が好ましい。

【0063】本発明の範疇で化粧品スティックとしての使用に適宜な通常の基剤物質は、流体油（例えばパラフィン油、ヒマシ油、ミリスチン酸イソプロピル）、半固体成分（例えばワセリン、ラノリン）、固体成分（例えば蜜蝋、セレシン及び微結晶ワックス及びオゾケライト）並びに高融点ワックス（例えばカルナバワックス、カンデリラワックス）である。

【0064】エアゾール容器から噴霧することができる、本発明の範疇の化粧品及び／又は皮膚科学的調製物のために適宜な噴射剤は、それら自体でも、相互の混合物としても使用することができる、通常の、知られた、揮発し易い液化噴射剤、例えば炭化水素（プロパン、ブタン、イソブタン）である。圧縮空気もまた好都合であ

る。

【0065】当業者は明らかに、それら自体無毒であり、そして原則的には本発明をエアゾール調製物の形態で実現するのに適宜であろうが、環境又はその他の付随する状況に対するそれらの有害な影響のために、回避せねばならない噴射ガス、なかでもフッ素化炭化水素及び塩化フッ化炭素（CFC）があることを知っている。

【0066】本発明の範疇の化粧品調製物はまた、有効量の本発明による活性成分及びそのために通常使用される溶媒、好ましくは水に加えて、有機増粘剤、例えばアラビアゴム、キサンタンゴム、アルギン酸ナトリウム、セルロース誘導体、好ましくは、メチルセルロース、ヒドロキシメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロー

W/Oクリーム

パラフィン油（DAB9）  
ペトロラタム  
羊毛ワックスアルコール  
PEG-7水素化ヒマシ油  
ステアリン酸アルミニウム  
フェルラ酸DL- $\alpha$ -トコフェリル  
グリセロール  
保存剤、染料、香料  
水

（実施例2）

W/Oローション

パラフィン油（DAB9）  
ペトロラタム  
セスキイソステアリン酸グルコース  
ステアリン酸アルミニウム  
フェルラ酸DL- $\alpha$ -トコフェリル  
酢酸 $\alpha$ -トコフェリル  
グリセロール  
保存剤、染料、香料  
水

（実施例3）

O/Wローション

パラフィン油（DAB9）  
パルミチン酸イソプロピル  
ペトロラタム  
セチルステアリルアルコール  
PEG-40ヒマシ油  
硫酸セチルステアリルナトリウム  
カーボマーナトリウム  
フェルラ酸DL- $\alpha$ -トコフェリル  
グリセロール  
 $\alpha$ -トコフェロール  
メトキシケイ皮酸オクチル

ス、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、あるいは無機増粘剤、例えば、ベントナイトのようなケイ酸アルミニウム、又はポリエチレングリコールとステアリン酸もしくはジステアリン酸ポリエチレングリコールの混合物、をも含有する、ゲルとして存在することもできる。増粘剤は例えば、0.1と30重量%の間、好ましくは0.5と15重量%の間の量でゲル中に含有される。

【0067】下記の実施例は本発明を具体的に表すために示される。

【0068】

【実施例】

（実施例1）

重量%

10.00  
4.00  
1.00  
3.00  
0.40  
0.50  
2.00  
適量  
全100.00

重量%

20.00  
4.00  
2.00  
0.40  
0.50  
1.00  
5.00  
適量  
全100.00

重量%

8.00  
3.00  
4.00  
2.00  
0.50  
0.50  
0.40  
0.50  
3.00  
0.20  
5.00

(実施例 4)	ブチルメトキシジベンゾイルメタン	1.00
	保存剤、染料、香料	適量
	水	全100.00
	○/Wクリーム	
(実施例 5)		重量%
	パラフィン油 (DAB 9)	7.00
	アボカド油	4.00
	モノステアリン酸グリセリル	2.00
	フェルラ酸DL- $\alpha$ -トコフェリル	0.50
	二酸化チタン	1.00
	乳酸ナトリウム	3.00
	グリセロール	3.00
	保存剤、染料、香料	適量
	水	全100.00
	リポソーム含有ゲル	
		重量%
	レシチン	6.00
	シアバター	3.00
(実施例 6)	フェルラ酸DL- $\alpha$ -トコフェリル	0.50
	$\alpha$ -トコフェロール	0.20
	ビオチン	0.08
	クエン酸ナトリウム	0.50
	グリシン	0.20
	尿素	0.20
	P C Aナトリウム	0.50
	加水分解コラーゲン	2.00
	キサンタンゴム	1.40
	ソルビトール	3.00
	保存剤、染料、香料	適量
	水	全100.00
	日焼け止めエマルション	
		重量%
(実施例 7)	シクロメチコン	2.00
	セチルジメチコン・コポリオール	0.20
	PEG-22ドデシル・コポリマー	3.00
	パラフィン油 (DAB 9)	2.00
	カプリル酸/カプリン酸トリグリセリド	5.80
	メトキシケイ皮酸オクチル	5.80
	ブチルメトキシジベンゾイルメタン	4.00
	フェルラ酸DL- $\alpha$ -トコフェリル	0.50
	酢酸 $\alpha$ -トコフェリル	0.50
	Z n S O <sub>4</sub>	0.70
	N a <sub>4</sub> E D T A	0.30
	保存剤、染料、香料	適量
	水	全100.00
	日焼け止めエマルション	

	重量%
シクロメチコン	2.00
セチルステアリルアルコール+	
PEG-40水素化ヒマシ油+	
硫酸セチルステアリルナトリウム	2.50
ラノリン酸グリセリル	1.00
カプリル酸/カプリン酸トリグリセリド	0.10
ラウリルメチコン・コポリオール	2.00
ステアリン酸オクチル	3.00
ヒマシ油	4.00
グリセロール	3.00
アクリルアミド/アクリル酸ナトリウム	
・コポリマー	0.30
ヒドロキシプロピルメチルセルロース	0.30
メトキシケイ皮酸オクチル	5.00
ブチルメトキシジベンゾイルメタン	0.50
フェルラ酸DL- $\alpha$ -トコフェリル	0.50
酢酸 $\alpha$ -トコフェリル	1.00
Na <sub>4</sub> HEDTA	1.50
保存剤、染料、香料	適量
水	全100.00

(実施例8)

日焼け止めエマルション	
	重量%
シクロメチコン	2.00
セチルステアリルアルコール+	
PEG-40水素化ヒマシ油+	
硫酸セチルステアリルナトリウム	2.50
ラノリン酸グリセリル	1.00
カプリル酸/カプリン酸トリグリセリド	0.10
ラウリルメチコン・コポリオール	2.00
ステアリン酸オクチル	3.00
ヒマシ油	4.00
グリセロール	3.00
アクリルアミド/アクリル酸ナトリウム	
・コポリマー	0.30
ヒドロキシプロピルメチルセルロース	0.30
メトキシケイ皮酸オクチル	5.00
ブチルメトキシジベンゾイルメタン	0.75
フェルラ酸DL- $\alpha$ -トコフェリル	0.50
Na <sub>4</sub> HEDTA	1.50
保存剤、染料、香料	適量
水	全100.00

(実施例9)

スプレー調製物	
	重量%
$\alpha$ -トコフェロール	0.10
フェルラ酸DL- $\alpha$ -トコフェリル	0.50
エタノール	28.20
保存剤、染料、香料	適量

本発明に従う主な態様を以下に示す。

【0069】1. 皮膚の、望ましくない色素沈着に対するフェルラ酸トコフェリルの使用。

2. 前記フェルラ酸トコフェリルが、化粧品又は皮膚科学的調製物中に有効量存在することを特徴とする、前記1項に記載の使用。

【0070】3. 選ばれたフェルラ酸トコフェリル

が、フェルラ酸DL- $\alpha$ -トコフェリルであることを特徴とする、前記1項記載の使用。

【0071】4. 前記フェルラ酸トコフェリル（類）が、調製物の総重量の0.01から10重量%、好ましくは0.1から5重量%、特に0.2から2.0重量%の濃度で、化粧品又は局所用皮膚科学的調製物中に存在することを特徴とする、前記2項記載の使用。

---

フロントページの続き

(72)発明者 ウベ・シエンロク  
ドイツ・デー23866ナーエ・レルヘンペ  
ーク33

(72)発明者 ハイナー・マツクス  
ドイツ・デー22297ハンプルク・クロフ  
マンシユトラーセ82ベー

(72)発明者 ウルリヒ・ククス  
千葉県浦安市明海13望海の街8-2007

(72)発明者 井上 和郎  
神奈川県横浜市中区新山下3-15新山下ベ  
イシテイ3-201

## USE OF TOCOPHERYL FERULATE FOR MAKING SKIN LESS BROWN AND PREVENTING SUNBURN, IN PARTICULAR THAT CAUSED BY ULTRAVIOLET RAY

**Publication number:** JP10120542

**Publication date:** 1998-05-12

**Inventor:** SCHOENROCK UWE DR; MAX HEINER DR; URURIHI KUKUSU; INOUE KAZUO

**Applicant:** BEIERSDORF AG; ICHIMARU PHARCOS INC

**Classification:**

- **international:** **A61K8/00; A61K8/14; A61K8/49; A61K8/67; A61K31/355; A61Q17/04; A61K8/00; A61K8/14; A61K8/30; A61K31/352; A61Q17/04; (IPC1-7): A61K7/42**

- **European:** A61K8/49H; A61K8/67L; A61K31/355; A61Q17/04

**Application number:** JP19970271934 19970919

**Priority number(s):** DE19961038534 19960920

**Also published as:**



DE19638534 (A1)

[Report a data error here](#)

### Abstract of **JP10120542**

**PROBLEM TO BE SOLVED:** To provide a method for producing a cosmetic or dermatological product which can prevent or treat undesirable pigmentation by use of tocopheryl ferulate. **SOLUTION:** This method uses tocopheryl ferulate, preferably DL-alpha- tocopheryl ferulate, an active ingredient which can prevent or treat undesirable pigmentation, particularly effective against exasperated local pigmentation, and abnormal pigmentation, such as mole and freckles, and a sunburn caused by ultraviolet ray. Therefore, it is possible to produce a cosmetic or dermatological product for local use by incorporating 0.01 to 10wt.% of tocopheryl ferulate as its active ingredient. The cosmetic or dermatological product is also particularly suited for treatment of a senile mole.

.....  
Data supplied from the **esp@cenet** database - Worldwide